

第 I 欄 報告の基礎

1. 言語に関し、この予備審査報告は以下のものを基礎とした。

- ☒ 出願時の言語による国際出願
☐ 出願時の言語から次の目的のための言語である _____ 語に翻訳された、この国際出願の翻訳文
☐ 国際調査 (PCT規則12.3(a)及び23.1(b))
☐ 国際公開 (PCT規則12.4(a))
☐ 国際予備審査 (PCT規則55.2(a)又は55.3(a))

2. この報告は下記の出願書類を基礎とした。(法第6条(PCT14条)の規定に基づく命令に応答するために提出された差替え用紙は、この報告において「出願時」とし、この報告に添付していない。)

☒ 出願時の国際出願書類

☐ 明細書

第 _____ ページ、出願時に提出されたもの
 第 _____ ページ*、 _____ 付かで国際予備審査機関が受理したもの
 第 _____ ページ*、 _____ 付かで国際予備審査機関が受理したもの

☐ 請求の範囲

第 _____ 項、出願時に提出されたもの
 第 _____ 項*、PCT19条の規定に基づき補正されたもの
 第 _____ 項*、 _____ 付かで国際予備審査機関が受理したもの
 第 _____ 項*、 _____ 付かで国際予備審査機関が受理したもの

☐ 図面

第 _____ ページ/図、出願時に提出されたもの
 第 _____ ページ/図*、 _____ 付かで国際予備審査機関が受理したもの
 第 _____ ページ/図*、 _____ 付かで国際予備審査機関が受理したもの

☐ 配列表又は関連するテーブル

配列表に関する補充欄を参照すること。

3. ☐ 補正により、下記の書類が削除された。

- ☐ 明細書 第 _____ ページ
☐ 請求の範囲 第 _____ 項
☐ 図面 第 _____ ページ/図
☐ 配列表 (具体的に記載すること) _____
☐ 配列表に関連するテーブル (具体的に記載すること) _____

4. ☐ この報告は、補充欄に示したように、この報告に添付されかつ以下に示した補正が出願時における開示の範囲を超えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c))

- ☐ 明細書 第 _____ ページ
☐ 請求の範囲 第 _____ 項
☐ 図面 第 _____ ページ/図
☐ 配列表 (具体的に記載すること) _____
☐ 配列表に関連するテーブル (具体的に記載すること) _____

* 4. に該当する場合、その用紙に "superseded" と記入されることがある。

第V欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条(PCT35条(2))に定める見解、
それを裏付ける文献及び説明

1. 見解

| | | |
|----------------|------------|---|
| 新規性 (N) | 請求の範囲 1-10 | 有 |
| | 請求の範囲 | 無 |
| 進歩性 (IS) | 請求の範囲 | 有 |
| | 請求の範囲 1-10 | 無 |
| 産業上の利用可能性 (IA) | 請求の範囲 1-10 | 有 |
| | 請求の範囲 | 無 |

2. 文献及び説明 (PCT規則 70.7)

文献1 : JP 2002-505668 A (ウイメン アント インファンツ ホスピタル) 2002.02.19 & WO 98/51678 A1 & C A 2289209 A & AU 9874936 A & AU 743514 B & EP 981523 A1 & US 6100294 A & US 612131 2 A & US 6479538 B1 & US 2003/125309 A1

文献2 : JP 63-107929 A (中外製薬株式会社) 1988.05.12 ファミリーなし

文献3 : JP 10-072432 A (中外製薬株式会社) 1998.03.17 & CA 2259339 A & AU 9731073 A & EP 924199 A1 & CN 1223639 A & IL 127861 A & US 2002/111503 A1 & US 6448421 B2 & KR 2000022113 A & US 2003/018206 A1 & US 6831183 B2 & US 2005/009794 A1 & WO 98/00 397 A1

文献4 : JP 06-087750 A (大洋薬品工業株式会社) 1994.03.29 ファミリーなし

文献5 : JP 05-004925 A (帝国化学産業株式会社) 1993.01.14 ファミリーなし

文献6 : JP 02-215765 A (株式会社ほくさん) 1990.08.28 ファミリーなし

文献7 : JP 06-041060 A (デュファール・インターナショナル・リサーチ・ペーパー・ブイ) 1994.02.15 & EP 558119 A2 & ES 2140433 T3 & CA 2090264 A & US 5304291 A & IL 104844 A

文献8 : WO 01/090061 A1 (中外製薬株式会社) 2001.11.29 & AU 2001056791 A & EP 12842 59 A1 & US 2003/092687 A1 & US 2005/032754 A1

補充欄

いずれかの欄の大きさが足りない場合

第 V 欄の続き

[1] 請求の範囲 1-9 に記載された発明は、国際調査報告で引用された上記文献 1-7 により進歩性を有しない。

文献 1-3 には、有用な生理活性を有する活性型ビタミンD₃誘導体として、(5Z, 7E)- (1R, 2R, 3R)-2-(3-ヒドロキシプロポキシ)-9, 10-セココレスタ5, 7, 10(19)-トリエン-1, 3, 25-トリオール(以下、「ED-71」とする)が記載されており、文献 1 及び 2 には、組成物とする際に油脂と安定化剤を含むことが、文献 1 には添加し得る抗酸化剤が、記載されている(文献 1 第 29-31 頁、文献 2 第 5 頁参照)。

一方、一般に、活性型ビタミンD₃誘導体は光等に対して不安定で酸化され易く、油剤と抗酸化剤とで有効に安定化し得ることが知られており、文献 4 及び 5 には、好適な添加量についても、記載されている(文献 4 全文、文献 5 全文参照)。

そうしてみると、ED-71 についても、同様の方法で安定化することは当業者が容易に行い得ることである。

また、安定化の結果として、ビタミンD体のトランス異性体、タキステロール型異性体等(必要であれば文献 3 第 3 頁、文献 6 第 3 頁、文献 7 第 3 頁等参照)、不純物の生成が抑制されることは当然の結果であり、これを格別の効果とすることはできない。

[2] 請求の範囲 10 に記載された発明は、国際調査報告で引用された上記文献 1-8 により進歩性を有しない。

上記 [1] 参照。

文献 1-3 には、有用な生理活性を有する活性型ビタミンD₃誘導体として、ED-71 が記載されている。

文献 8 には、公知の 5Z 配置のビタミンD₃誘導体に対して、5E 配置の異性体を合成し、生理活性を検討することが記載されており(文献 8 第 6 頁参照)、文献 6 には光反応でシストランス変換を行い得ることも記載されている(文献 6 第 3 頁参照)。

そうしてみると、ED-71 についても、同様にトランス体を想到することは、当業者が容易に行い得ることである。